

**ПОДХОД К СИНТЕЗУ 10-ЧЛЕННЫХ ЕНДИИНОВ,
КОНДЕНСИРОВАННЫХ С ИНДОЛОМ***Дьяченко А.С., Данилкина Н.А.*Санкт-Петербургский государственный университет
199034, г. Санкт-Петербург, Университетская наб., д. 7/9

Ендииновые антибиотики – биологически активные соединения с выраженным противоопухолевым действием, что обусловлено способностью (Z)-гекс-3-ен-1,5-дииновой системы, включенной в 9- или 10-членный цикл, претерпевать циклизацию Бергмана даже при 37 °С [1]. Природные ендиины нестабильны и токсичны, поэтому поиск их аналогов является актуальной задачей.

Цель данной работы заключалась в разработке подхода к синтезу 10-членного ендиина **6**, аннелированного с индолом (см. схему).

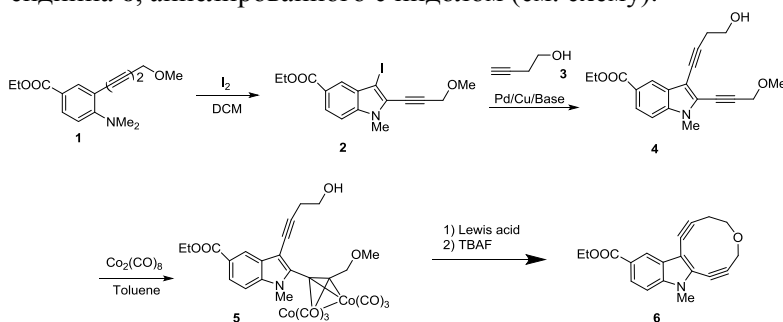


Схема синтеза 10-членного ендиина.

Синтез основан на электрофильной циклизации MeOCH_2 -замещенного *o*-(бута-1,3-диинил)-*N,N*-диметиланилина **1**, приводящей к индолу **2**, и реакции Соногаширы соединения **2** с бут-3-ин-1-олом **3**, содержащим необходимую для макроциклизации нуклеофильную функциональную группу OH. $\text{Co}_2(\text{CO})_6$ -комплекс **5** был получен из ендиина **4** с высоким выходом и высокой региоселективностью по тройной связи в положении 2 индольного кольца. Наблюдаемую региоселективность можно объяснить большей стабильностью Со-комплексов с MeOCH_2 -замещенной тройной связью ввиду ее меньшей электронной плотности по сравнению с тройными связями в положении 3 [2]. Реакционная способность полученного комплекса в макроциклизации по Николасу изучается.

1. Maretina I.A., Trofimov B.A. // Russ. Chem. Rev. 2006. V. 75. P. 825–845.

2. Lyapunova A.G., Danilkina N.A., Khlebnikov A.F. et al. // Eur. J. Org. Chem. 2016. P. 4842–4851.

Работа выполнена при финансовой поддержке гранта РФФИ 17-03-00910 с использованием оборудования ресурсных центров СПбГУ – «Магнитно-резонансные методы исследования», «Методы анализа состава вещества» и Образовательный ресурсный центр по направлению «Химия».